#### (19) 世界知的所有権機関 国際事務局



# - 1 CLOS BURGOS DE SECONO DE SECONO DE LA COLECTIO DE LA COLECTIO DE LA COLECTION DE LA COLECT

#### (43) 国際公開日 2002 年11 月7 日 (07.11.2002)

#### **PCT**

## (10) 国際公開番号 WO 02/088110 A1

(51) 国際特許分類? C07D 401/12, 403/12, 413/12, 417/12, A61K 31/4709, 31/517, A61P 3/10, 9/10, 17/06, 19/02, 29/00, 35/00

(21) 国際出願番号:

PCT/JP02/04279

(22) 国際出願日:

2002 年4 月26 日 (26.04.2002)

(25) 国際出願の言語:

日本語

(26) 国際公開の言語:

日本語

(30) 優先権データ:

特願2001-132775 2001 年4 月27 日 (27.04.2001) JP

(71) 出願人 *(*米国を除く全ての指定国について*)*: 麒麟 麦酒株式会社 (KIRIN BEER KABUSHIKI KAISHA) [JP/JP]; 〒104-8288 東京都 中央区 新川二丁目 1 〇番 1号 Tokyo (JP).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 久保 和生(KUBO,Kazuo) [JP/JP]; 〒370-0852 群馬県 高崎市 中居町 4-1 7-9 キリン中居寮 2 0 7 号室 Gunma (JP). 酒井輝行 (SAKAI,Teruyuki) [JP/JP]; 〒370-1207 群馬県高崎市綿貫町 9 0 6-7 Gunma (JP). 長尾里佳 (NAGAO,Rika) [JP/JP]; 〒370-1202 群馬県高崎市宮原町 1 1 宮原社宅A-2 0 4 Gunma (JP). 藤原康成 (FUJIWARA,Yasunari) [JP/JP]; 〒331-0043 埼玉県さいたま市大成町 1-5 3 9-1-1 0 2 Saitama (JP). 磯江 敏幸 (ISOE,Toshiyuki) [JP/JP]; 〒370-1206 群馬

県 高崎市 台新田町 3 3 0 - 2 8 Gunma (JP). 長谷川和正 (HASEGAWA,Kazumasa) [JP/JP]; 〒370-1202 群馬県 高崎市 宮原町 1 1 宮原社宅B-4 0 1 Gunma (JP).

- (74) 代理人: 吉武 賢次, 外(YOSHITAKE,Kenji et al.); 〒 100-0005 東京都 千代田区 丸の内三丁目 2番 3 号 富 士ビル 3 2 3 号 協和特許法律事務所 Tokyo (JP).
- (81) 指定国 (国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZM, ZW.
- (84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特許 (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, TR), OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

#### 添付公開書類:

#### - 国際調査報告書

2 文字コード及び他の略語については、定期発行される各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

- (54) Title: QUINOLINE DERIVATIVE HAVING AZOLYL GROUP AND QUINAZOLINE DERIVATIVE
- (54) 発明の名称: アゾリル基を有するキノリン誘導体およびキナゾリン誘導体

$$\begin{array}{c|c}
R^{5} & R^{9} & R^{10} \\
\hline
R^{5} & R^{9} & R^{10} \\
\hline
R^{7} & R^{8} & R^{11} \\
\hline
R^{3} & R^{4} & R^{11}
\end{array}$$
(1)

(57) Abstract: A compound having strong antitumor activity. It is a compound represented by the formula (I) or a pharmaceutically acceptable salt or solvate thereof: (I) wherein X and Z each represents CH or nitrogen; Y represents oxygen or sulfur; R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, and R<sup>3</sup> each represents hydrogen, alkoxy, etc.; R<sup>4</sup> represents hydrogen; R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, and R<sup>8</sup> each represents hydrogen, halogeno, alkoxy, etc.; R<sup>9</sup> and R<sup>10</sup> each represents hydrogen, alkyl, etc.; and R<sup>11</sup> represents optionally substituted azolyl.

#### (57) 要約:

本発明は強力な抗腫瘍活性を有する化合物の提供をその目的とする。本発明による化合物は、式(I)の化合物、またはそれらの薬学上許容される塩もしくは溶媒和物である。

$$\begin{array}{c|c}
R^{5} & R^{9} & R^{10} \\
\hline
R^{5} & N & N & N
\end{array}$$

$$\begin{array}{c|c}
R^{1} & R^{10} & N & N
\end{array}$$

$$\begin{array}{c|c}
R^{1} & N & N
\end{array}$$

(式中、XおよびZはCHまたはNを表し、YはOまたはSを表し、R1、R2、R3はH、Pルコキシ等を表し、R4はHを表し、R5、R6、R7、R8はH、N0 ゲン、Pルコキシ等を表し、R8、R10はH、Pルキル等を表し、R11は置換されていてもよいアゾリル基を表す)

## (19)日本国特許庁 (JP) (12) 公開特許公報 (A)

(11)特許出願公開番号

特開2003-12668 (P2003-12668A)

(43)公開日 平成15年1月15日(2003.1.15)

(51) Int.Cl.7		識別記号		FΙ			デ	-7]}*(参考)
C 0 7 D 40	1/12			C07D	401/12			4 C 0 6 3
A61K 3	31/4709			A 6 1 K	31/4709			4C086
3	31/517				31/517			
A 6 1 P	3/10			A 6 1 P	3/10			
	9/10	101			9/10		101	
			審查請求	有 請	求項の数31	OL	(全 34 頁)	最終頁に続く

特顧2002-126869(P2002-126869) (21)出願番号

(22)出顧日 平成14年4月26日(2002.4.26)

(31) 優先権主張番号 特願2001-132775 (P2001-132775)

(32)優先日 平成13年4月27日(2001.4.27)

(33)優先権主張国 日本(JP) (71)出顧人 000253503

麒麟麦酒株式会社

東京都中央区新川二丁目10番1号

(72)発明者 久 保 和 生

群馬県高崎市中居町4-17-9 キリン中

居寮207号

(72)発明者 酒 井 輝 行

群馬県高崎市綿貫町906-7

(72)発明者 長 尾 里 佳

群馬県高崎市宮原町11 宮原社宅A-204

(74)代理人 100075812

弁理士 吉武 賢次 (外3名)

最終頁に続く

#### (54) 【発明の名称】 アゾリル基を有するキノリン誘導体およびキナゾリン誘導体

#### (57)【要約】

【課題】 強力な抗腫瘍活性を有する化合物の提供。

【解決手段】 本発明による化合物は、式(1)の化合 物、またはそれらの薬学上許容される塩もしくは溶媒和 物である。

## 【化1】

(式中、XおよびZはCHまたはNを表し、YはOまた はSを表し、R1、R2、R3はH、アルコキシ等を表 し、R4はHを表し、R5、R6、R7、R8はH、ハ ロゲン、アルコキシ等を表し、R9、R10はH、アル キル等を表し、R11は置換されていてもよいアゾリル

基を表す)